

11-10-05
VERTRAG ÜBER DIE INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM
GEBIET DES PATENTWESENS

10/551,621

PCT


INTERNATIONALER VORLÄUFIGER BERICHT ÜBER DIE
PATENTIERBARKEIT

(Kapitel II des Vertrags über die internationale Zusammenarbeit auf dem Gebiet des Patentwesens)

REC'D 14 OCT 2005

WIPO

PCT

Aktenzeichen des Anmelders oder Anwalts 13232WO/ko	WEITERES VORGEHEN siehe Formblatt PCT/PEA/416	
Internationales Aktenzeichen PCT/EP2004/003400	Internationales Anmeldedatum (Tag/Monat/Jahr) 31.03.2004	Prioritätsdatum (Tag/Monat/Jahr) 02.04.2003
Internationale Patentklassifikation (IPK) oder nationale Klassifikation und IPK A61K9/48, A61K47/10, A61K35/78		
Anmelder BIOPLANTA ARZNEIMITTEL GMBH		
<p>1. Bei diesem Bericht handelt es sich um den internationalen vorläufigen Prüfungsbericht, der von der mit der internationalen vorläufigen Prüfung beauftragten Behörde nach Artikel 35 erstellt wurde und dem Anmelder gemäß Artikel 36 übermittelt wird.</p> <p>2. Dieser BERICHT umfaßt insgesamt 8 Blätter einschließlich dieses Deckblatts.</p> <p>3. Außerdem liegen dem Bericht ANLAGEN bei; diese umfassen</p> <p>a. <input type="checkbox"/> (an den Anmelder und das Internationale Büro gesandt) insgesamt Blätter; dabei handelt es sich um</p> <p><input type="checkbox"/> Blätter mit der Beschreibung, Ansprüchen und/oder Zeichnungen, die geändert wurden und diesem Bericht zugrunde liegen, und/oder Blätter mit Berichtigungen, denen die Behörde zugestimmt hat (siehe Regel 70.16 und Abschnitt 607 der Verwaltungsvorschriften).</p> <p><input type="checkbox"/> Blätter, die frühere Blätter ersetzen, die aber aus den in Feld Nr. 1, Punkt 4 und im Zusatzfeld angegebenen Gründen nach Auffassung der Behörde eine Änderung enthalten, die über den Offenbarungsgehalt der internationalen Anmeldung in der ursprünglich eingereichten Fassung hinausgeht.</p> <p>b. <input type="checkbox"/> (nur an das Internationale Büro gesandt) insgesamt (bitte Art und Anzahl der/des elektronischen Datenträger(s) angeben), der/die ein Sequenzprotokoll und/oder die dazugehörigen Tabellen enthält/enhalten, nur in computerlesbarer Form, wie im Zusatzfeld betreffend das Sequenzprotokoll angegeben (siehe Abschnitt 802 der Verwaltungsvorschriften).</p> <p>4. Dieser Bericht enthält Angaben zu folgenden Punkten:</p> <p><input checked="" type="checkbox"/> Feld Nr. I Grundlage des Bescheids</p> <p><input type="checkbox"/> Feld Nr. II Priorität</p> <p><input type="checkbox"/> Feld Nr. III Keine Erstellung eines Gutachtens über Neuheit, erfinderische Tätigkeit und gewerbliche Anwendbarkeit</p> <p><input type="checkbox"/> Feld Nr. IV Mangelnde Einheitlichkeit der Erfindung</p> <p><input checked="" type="checkbox"/> Feld Nr. V Begründete Feststellung nach Artikel 35(2) hinsichtlich der Neuheit, der erfinderischen Tätigkeit und der gewerblichen Anwendbarkeit; Unterlagen und Erklärungen zur Stützung dieser Feststellung</p> <p><input type="checkbox"/> Feld Nr. VI Bestimmte angeführte Unterlagen</p> <p><input type="checkbox"/> Feld Nr. VII Bestimmte Mängel der internationalen Anmeldung</p> <p><input type="checkbox"/> Feld Nr. VIII Bestimmte Bemerkungen zur internationalen Anmeldung</p>		
Datum der Einreichung des Antrags 01.02.2005	Datum der Fertigstellung dieses Berichts 18.07.2005	
Name und Postanschrift der mit der internationalen Prüfung beauftragten Behörde  Europäisches Patentamt D-80298 München Tel. +49 89 2399 - 0 Tx: 523656 epmu d Fax: +49 89 2399 - 4465	Bevollmächtigter Bediensteter Baumgärtner, H Tel. +49 89 2399-8480	



Feld Nr. I Grundlage des Berichts

1. Hinsichtlich der **Sprache** beruht der Bericht auf der internationalen Anmeldung in der Sprache, in der sie eingereicht wurde, sofern unter diesem Punkt nichts anderes angegeben ist.
- ☐ Der Bericht beruht auf einer Übersetzung aus der Originalsprache in die folgende Sprache, bei der es sich um die Sprache der Übersetzung handelt, die für folgenden Zweck eingereicht worden ist:
- ☐ internationale Recherche (nach Regeln 12.3 und 23.1 b))
 - ☐ Veröffentlichung der internationalen Anmeldung (nach Regel 12.4)
 - ☐ internationale vorläufige Prüfung (nach Regeln 55.2 und/oder 55.3)
2. Hinsichtlich der **Bestandteile*** der internationalen Anmeldung beruht der Bericht auf *(Ersatzblätter, die dem Anmeldeamt auf eine Aufforderung nach Artikel 14 hin vorgelegt wurden, gelten im Rahmen dieses Berichts als "ursprünglich eingereicht" und sind ihm nicht beigelegt)*:

Beschreibung, Seiten

2-7

In der ursprünglich eingereichten Fassung

1

eingegangen am 01.02.2005 mit Schreiben vom 01.02.2005

Ansprüche, Nr.

1-12

eingegangen am 01.02.2005 mit Schreiben vom 01.02.2005

- ☐ einem Sequenzprotokoll und/oder etwaigen dazugehörigen Tabellen - siehe Zusatzfeld betreffend das Sequenzprotokoll
3. ☐ Aufgrund der Änderungen sind folgende Unterlagen fortgefallen:
- ☐ Beschreibung: Seite
 - ☐ Ansprüche: Nr.
 - ☐ Zeichnungen: Blatt/Abb.
 - ☐ Sequenzprotokoll (*genaue Angaben*):
 - ☐ etwaige zum Sequenzprotokoll gehörende Tabellen (*genaue Angaben*):
4. ☐ Dieser Bericht ist ohne Berücksichtigung (von einigen) der diesem Bericht beigelegten und nachstehend aufgelisteten Änderungen erstellt worden, da diese aus den im Zusatzfeld angegebenen Gründen nach Auffassung der Behörde über den Offenbarungsgehalt in der ursprünglich eingereichten Fassung hinausgehen (Regel 70.2 c)).
- ☐ Beschreibung: Seite
 - ☐ Ansprüche: Nr.
 - ☐ Zeichnungen: Blatt/Abb.
 - ☐ Sequenzprotokoll (*genaue Angaben*):
 - ☐ etwaige zum Sequenzprotokoll gehörende Tabellen (*genaue Angaben*):

* Wenn Punkt 4 zutrifft, können einige oder alle dieser Blätter mit der Bemerkung "ersetzt" versehen werden.

**INTERNATIONALER VORLÄUFIGER BERICHT
ÜBER DIE PATENTIERBARKEIT**

Internationales Aktenzeichen
PCT/EP2004/003400

Feld Nr. V Begründete Feststellung nach Artikel 35 (2) hinsichtlich der Neuheit, der erfinderischen Tätigkeit und der gewerblichen Anwendbarkeit; Unterlagen und Erklärungen zur Stützung dieser Feststellung

1. Feststellung
- | | |
|--------------------------------|----------------------|
| Neuheit (N) | Ja: Ansprüche |
| | Nein: Ansprüche 1-12 |
| Erfinderische Tätigkeit (IS) | Ja: Ansprüche |
| | Nein: Ansprüche 1-12 |
| Gewerbliche Anwendbarkeit (IA) | Ja: Ansprüche: 1-12 |
| | Nein: Ansprüche: |

2. Unterlagen und Erklärungen (Regel 70.7):

siehe Beiblatt

Zu Punkt V

Begründete Feststellung hinsichtlich der Neuheit, der erfinderischen Tätigkeit und der gewerblichen Anwendbarkeit; Unterlagen und Erklärungen zur Stützung dieser Feststellung

Gegenstand der Ansprüche:

Ansprüche 1-6 (vgl. frühere Produktansprüche 1-6) umformuliert in zweite nicht-medizinische Verwendungsansprüche.

- A1 Verwendung eines polyphenolhaltigen Pflanzenextraktes zur Verzögerung der Freisetzung des Inhalts von Gelatinekapseln, wobei der polyphenolhaltige Pflanzenextrakt Bestandteil des Kapselinhalts ist.
- a2 Kapselinhalt: polyphenolhaltiger Pflanzenextrakt und flüssiger, mit Wasser nicht-mischbarer Trägerstoff
- a3 polyphenolhaltiger Pflanzenextrakt z.B. aus Camellia sinensis, Crataegus monogyna, Ginkgo biloba, Humulus lupulus [...] Vaccinium myrtillus etc.
- a4 flüssiger, mit Wasser nicht-mischbarer Trägerstoff: ungesättigte Öle (insb. mit hohem omega-3-Fettsäure Gehalt).
- a5 flüssiger, mit Wasser nicht-mischbarer Trägerstoff: Perillasamenöl, Nachtkerzensamenöl [...] Fischöl, Borretschöl, Leinöl
- a6 Kapselinhalt enthält weitere Stoffe: Pflanzenöle, Bienenwachs, Lecithin, Neutralöl, Hartfett, hochdisperses Siliciumdioxid, Sorbitanmonooleat

Ansprüche 7-12 - Verfahrensansprüche zur "Verzögerung der Freisetzung".

- A7 Verwendung zur Verzögerung der Freisetzung des Inhalts von Gelatinekapseln, wobei ein polyphenolhaltiger Pflanzenextrakte, in den Kapselinhalt eingebracht wird

a8-a11 vgl. a2-a5

a12 vgl. a6

Im vorliegenden Bescheid wird auf folgende Dokumente verwiesen:

D1 : US 5 955 102 A (IBRAHIM NAGUI ET AL) 21. September 1999

diskutiert ein **Nahrungsergänzungsmittel** enthaltend **Docosahexansäure (DHA)**, Lutein and **Anthocyanoside** (Sp.1/Z.6-8)

- **Docosahexansäure (DHA)** und **Eicosapentansäure (EPA)** sind **Omega-3 (.omega.3)-polyungesättigte-Fettsäuren (PUFA)**, die natürlich in Ölen maritimer Herkunft enthalten sind (Sp.1/Z.11-13)

- **Anthocyanoside** ist eine Gruppe von rot bis blauen Pflanzenpigmenten, die als kondensierte Produkte (Glykoside) von Anthocyanen oder Anthocyanidinen kombiniert mit Zucker, wie z.B. Glucose, Arabinose oder Galactose vorkommen; Blaubeeren/Heidelbeeren enthalten eine Vielzahl von Anthocyanen eingeschlossen sind Cyanidine, Malvidine, Delphinidine, Petunidine and Peonidene; sie ähneln strukturell und funktionell Biflavonoiden (Sp.1/Z. 39-46)

das Nahrungsergänzungsmittel wird bevorzugt als Kapsel verabreicht und beinhaltet **flüssiges** oder trockenes **Inneres Füllmaterial** sowie eine äussere Hülle; in einem **bevorzugten Beispiel**, ist das **Innere Füllmaterial eine flüssige Mischung, das sich in einer Gelatinekapsel befindet**, eine sogenannte "softgel" Kapsel (Sp.2/I.31-35)

zumindest DHA, Lutein und mindestens ein Anthocyanosid sind Bestandteile des inneren Füllmaterials, "DHA" bedeutet die freie Säureform von **Docosahexansäure** nicht die Phospholipid- oder Esterform. Eine natürliche Quelle für DHA ist **Fischöl** (Sp.2/Z.36-39)

jede Quelle für **Anthocyanoside** kann verwendet werden, bevorzugt **Blaubeerextrakt** (d.h. **Vaccinium myrtillus**, ein kleines Staudengewächs, das aus Nordeuropa und Asien stammt)

D2 : EP 0 502 766 A (INST RECH BIOLOG SA) 9. September 1992

bezieht sich auf neue diätische Zusammensetzung, die zerebrale Phospholipide alleine oder in Verbindung mit tierischen Ölen (reich an ungesättigten Fettsäuren der Omega-3-Serie) zuführen soll (S.2/Z.1-5)

die **Öle der Kaltwassermeeresfische** (Kabeljau, Heilbutt, Hering...) sind reich an **DHA**

(S.2/Z.37-38)

die diätischen Zusammensetzungen können darüber hinaus **wie in Heidelbeerextrakt**
vorkommende **Anthocyanoside** enthalten (S.2/Z.53-54)
die Gabe der diätetischen Zubereitung erfolgt in Form von 2-4 Kapseln (S.3/Z.30)

D3 : GB 1 011 265 A (RIKEN VITAMIN OIL CO LTD; TAKEDA CHEMICAL INDUSTRIES LTD) 24. November 1965 (1965-11-24)

Anspruch 1 ein **Verfahren zur Herstellung eines Arzneimittels** für die Behandlung von
Hypercholesterolämie bestehend aus **Ölen von Meerestieren denen ein Antioxidans**
zugemischt ist (s. auch Seite 2/Sp.1/Z.5-7 und Sp.2/Z.95-102).

Anspruch 3 das **Antioxidans** ist u.a. **Propylgallate**, Butylhydroxyanisol, Butylhydroxytoluen,
Tocopherol

Anspruch 7 das **Arzneimittel** ist in Form einer **Kapsel**,

D4 : PATENT ABSTRACTS OF JAPAN

Bd. 0145, Nr. 62 (C-0788), 13.

Dezember 1990 (1990-12-13) &; JP 2 243622 A (NIPPON OIL &; FATS CO LTD), 27.
September 1990 (1990-09-27)

Fett und Öl Zubereitung bestehend aus (1) Öl und Fett, die alpha-Linolensäure,
Eicosapentensäure und/oder Docosahexensäure enthalten und (2)

rohes aus Teeblättern extrahiertes Catechin (Tea shinensis)

die alpha-Linolensäure findet sich z.B. in Leinöl, die Eicosapentensäure und
Docosahexensäure z.B. in **Fischöl**

die Zusammensetzung wird oral als **Kapsel** verabreicht

D5 : CN 1 279 072 A (GAO LIN) 10. Januar 2001 (2001-01-10)

Ein Arzneimittel in Form einer **Kapsel** enthaltend u.a. Nukleinsäurepulver,
Sojabohnenlecithinpulver, **Teepolyphenole**, [...], Linolensäurefischöl, Sesamöl etc.

D6 : EP0573777 A 19931215 (IdB Holding S.p.A.) 15. Februar 1993

beschreibt pharmazeutische orale Zubereitungen, die einen hohen Anteil an

Anthocyaneosiden (HCA) als aktives Wirkprinzip enthalten,
die Früchte vieler Pflanzen wie z.B. **Vaccinium myrtillus**, **Ribes nigrum**, **Vitis vinifera** and
Sambucus nigra sind Ausgangsmaterialien für die Herstellung von **Anthocyanosiden**

Neuheit (i), Erfinderische Tätigkeit (ii) und Industrielle Anwendbarkeit (iii) - Art. 33 (1)-(4)

i und ii.

Der Wortlaut des Anspruchs bzgl. der neuen Verwendung bekannter Substanzen in einer Kapsel offenbart keine technischen Merkmale, die eindeutig diese neue Verwendung reflektieren.

Abgesehen davon ist anzunehmen, dass die aus dem Stand der Technik bekannten Formulierungen die nun beanspruchte Eigenschaft bereits inhärent besitzen.

Des weiteren belegen die bislang vorgelegten Beispiele die beanspruchte Verwendung nicht überzeugend.

Es wurden keine Daten vorgelegt, die Zeugnis über die unerwartete Wirksamkeit und in diesem Zusammenhang über die beabsichtigte neue Verwendung "Verzögerung der Freisetzung des Inhalts von Gelatinekapseln" der polyphenolhaltigen Substanzen gegenüber bestehenden Formulierungen ablegen, vor allem nicht bzgl. der Freisetzung "jeglichen" Inhalts von Gelatinekapseln.

Laut Beschreibung S.7/Z.3-5 wird z.B. im Zusammenhang mit der "Prüfung der Zerfallszeit gemäss Europäischem Arzneibuch" von einer "Zerfallszeit vor der Lagerung = 4 min" gesprochen. Das sagt aber nichts aus über die Art und Weise der Zusammensetzung einer solchen Kapsel und ist insofern nicht aussagekräftig als Vergleich mit den Kapseln des Standes der Technik.

Demzufolge scheinen weder die Kriterien für Neuheit noch für erfinderische Tätigkeit zum

gegenwärtigen Zeitpunkt erfüllt.

JC20 Rec'd PCT/PTO 30 SEP 2001

Kapseln mit verzögerter Freisetzung des Kapselinhaltes zur oralen
Verabreichung

Die vorliegende Erfindung betrifft die Verwendung eines polyphenolhaltigen
5 Pflanzenextrakts zur Verzögerung der Freisetzung des Inhalts von
Gelatinekapseln.

Bei vielen Nahrungsergänzungsmitteln, Diätetika und Arzneimitteln ist es wün-
schenswert, daß der Wirkstoff erst eine bestimmte Zeit nach der Einnahme oder in
10 einem bestimmten Abschnitt des Magen-Darm-Traktes aus der Darreichungsform
freigegeben wird. Ziel dieser zeitlich oder örtlich gesteuerten Freisetzung ist es,
entweder den Verwender vor den unangenehmen Eigenschaften des Wirkstoffes
zu schützen (z.B. schlechter Geschmack, schleimhautreizende Wirkung, unange-
nehmes Aufstoßen) oder den Wirkstoff vor der Zerstörung durch den aggressiven
15 Magensaft zu schützen oder eine verbesserte Aufnahme der Wirkstoffe in den
Körper durch Freisetzung im Dünndarm zu erzielen.

Diese verzögerte Freisetzung ist insbesondere dann wünschenswert, wenn die zu
applizierenden Wirkstoffe Pflanzenextrakte sind, die bei einem zu schnellen Zerfall
20 der Kapsel einen unangenehmen Geschmack oder Geruch beim Aufstoßen zur
Folge haben oder Stoffe enthalten sind, die im Magen abgebaut werden können.

Eine bevorzugte Darreichungsform für diese Nahrungsergänzungsmittel, Diätetika
und Arzneimittel ist die Kapsel, die mit flüssigen, halbfesten oder festen Stoffen
25 befüllt werden kann und deren Hülle meist aus Gelatine besteht. Besonders ge-
eignet sind Weichgelatinekapseln, weil deren Herstellung, Befüllung und Ver-
schließen in einem Schritt erfolgt, der Kapselinhalt gut gegen Umwelteinflüsse wie
Feuchte und Sauerstoff geschützt ist und weil diese Kapseln sehr leicht einzu-
nehmen sind.

30

Ganz allgemein kann die Freisetzung von Stoffen im Magen-Darm-Trakt aus einer
Kapsel durch Veränderung des Kapselinhaltes oder durch Veränderung der Kap-

Patentansprüche

1. Verwendung eines polyphenolhaltigen Pflanzenextraktes zur Verzögerung der Freisetzung des Inhalts von Gelatinekapseln, wobei der polyphenolhaltige Pflanzenextrakt Bestandteil des Kapselinhalts ist.
2. Verwendung nach Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet, daß der Kapselinhalt einen polyphenolhaltigen Pflanzenextrakt und einen flüssigen, mit Wasser nicht-mischbaren Trägerstoff umfasst.
3. Verwendung nach Anspruch 1 oder 2, dadurch gekennzeichnet, daß der polyphenolhaltige Pflanzenextrakt aus mindestens einer der Pflanzen *Camellia sinensis*, *Crataegus monogyna*, *Ginkgo biloba*, *Humulus lupulus*, *Hypericum perforatum*, *Krameria triandra*, *Potentilla tomentosa*, *Pterocarpus marsupium*, *Quercus*-Arten, *Uncaria gambir*, *Vaccinium myrtillus* oder *Vitis vinifera* hergestellt wird.
4. Verwendung nach einem der Ansprüche 1 bis 3, dadurch gekennzeichnet, daß der flüssige, mit Wasser nicht-mischbare Trägerstoff ausgewählt ist aus der Gruppe der mehrfach ungesättigten Öle, insbesondere Ölen mit einem hohen Gehalt an omega-3-Fettsäuren.
5. Verwendung nach einem der Ansprüche 1 bis 4, dadurch gekennzeichnet, daß der flüssige, mit Wasser nicht-mischbare Trägerstoff ausgewählt ist aus Perillasamenöl, Nachtkerzensamenöl, Johannisbeerkernöl, Fischöl, Borretschöl und Leinöl.
6. Verwendung nach einem der Ansprüche 1 bis 5, dadurch gekennzeichnet, daß der Kapselinhalt weitere Stoffe enthält, ausgewählt aus der Gruppe umfassend Pflanzenöle, partiell oder vollständig hydrierte Pflanzenöle, Bienenwachs, Lecithin, Neutralöl, Hartfett, hochdisperses Siliciumdioxid und Sorbitanmonooleat.

7. Verfahren zur Verzögerung der Freisetzung des Inhalts von Gelatinekapseln, wobei ein polyphenolhaltiger Pflanzenextrakt in den Kapselinhalt eingebracht wird.
8. Verfahren nach Anspruch 7, dadurch gekennzeichnet, dass ein polyphenolhaltiger Pflanzenextrakt und ein flüssiger, mit Wasser nicht-mischbarer Trägerstoff in den Kapselinhalt eingebracht wird.
9. Verfahren nach Anspruch 7 oder 8, dadurch gekennzeichnet, dass der polyphenolhaltige Pflanzenextrakt aus mindestens einer der Pflanzen *Camellia sinensis*, *Crataegus monogyna*, *Ginkgo biloba*, *Humulus lupulus*, *Hypericum perforatum*, *Krameria triandra*, *Potentilla tomentosa*, *Pterocarpus marsupium*, *Quercus*-Arten, *Uncaria gambir*, *Vaccinium myrtillus* oder *Vitis vinifera* hergestellt wird.
10. Verfahren nach einem der Ansprüche 7 bis 9, dadurch gekennzeichnet, dass der flüssige, mit Wasser nicht-mischbare Trägerstoff ausgewählt ist aus der Gruppe der mehrfach ungesättigten Öle, insbesondere Ölen mit einem hohen Gehalt an omega-3-Fettsäuren.
11. Verfahren nach einem der Ansprüche 7 bis 10, dadurch gekennzeichnet, dass der flüssige, mit Wasser nicht-mischbare Trägerstoff ausgewählt ist aus Perillasamenöl, Nachtkerzensamenöl, Johannisbeerkernöl, Fischöl, Borretschöl und Leinöl.
12. Verfahren nach einem der Ansprüche 7 bis 11, dadurch gekennzeichnet, dass weitere Stoffe in den Kapselinhalt eingebracht werden, ausgewählt aus der Gruppe umfassend Pflanzenöle, partiell oder vollständig hydrierte Pflanzenöle, Bienenwachs, Lecithin, Neutralöl, Hartfett, hochdisperses Siliciumdioxid und Sorbitanmonooleat.